

Rec'd PCT/PTO 12 OCT 2004

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
23 octobre 2003 (23.10.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2003/086412 A3

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
A61K 31/66, A61P 31/04, A61K 7/22, 31/663

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2003/001178

(22) Date de dépôt international : 14 avril 2003 (14.04.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
02/04596 12 avril 2002 (12.04.2002) FR

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : UNI-  
VERSITE D'ANGERS [FR/FR]; 40, rue de Rennes,  
F-49000 Angers (FR). INSTITUT NATIONAL DE  
LA SANTE ET DE LA RECHERCHE MEDICALE  
(INSERM) [FR/FR]; 101, rue de Tolbiac, F-75013 Paris  
(FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : ~~VENIZOT~~,  
Benoît [FR/FR]; 79, boulevard Eugène Chaumin, F-49000  
Angers (FR) ~~DENIZOT~~, Anne [FR/FR]; 79, boulevard  
Eugène Chaumin, F-49000 Angers (FR). ~~HINDRE~~,  
François [FR/FR]; 45, boulevard de la Duchesse Anne,  
F-35700 Rennes (FR); ~~PORTET~~, David [FR/FR]; 8,  
impasse du Chêne Vert, F-49125 Tierce (FR).

(74) Mandataires : MARTIN, Jean-Jacques etc.; Cabinet  
Regimbeau, 20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17  
(FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,  
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,  
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,  
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet  
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,  
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv)) pour US  
seulement

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale  
— avec revendications modifiées

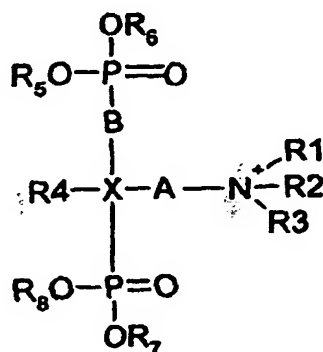
(88) Date de publication du rapport de recherche  
internationale: 1 avril 2004

Date de publication des revendications modifiées:  
27 mai 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: POLYPHOSPHONATE DERIVATIVES FOR TOOTHPASTE COMPOSITIONS

(54) Titre : DERIVES POLY-PHOSPHONATES POUR COMPOSITIONS DENTIFRICES



(57) Abstract: The invention relates to a medicament containing the polyphosphonate compound of general formula (I) as an active ingredient.

(57) Abrégé : Médicament contenant en tant que principe actif le composé polyphos-  
phonate de formule générale (I) destiné à inhiber l'apparition et le développement de la  
plaque dentaire dans laquelle : 1) R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub> représentent indépendam-  
ment l'un de l'autre un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle ou aryle en C1-C6 ; 2)  
X est un atome de carbone C ou un atome d'azote N ; 3) A représente un groupe alkyle  
ou aryle en C1-C6, un groupe carbonyle ou un groupe hydrophile, B et C représentent  
une liaison chimique, un groupe alkyle ou aryle en C1-C6, un groupe carbonyle, ou un  
groupe hydrophile.

(I)

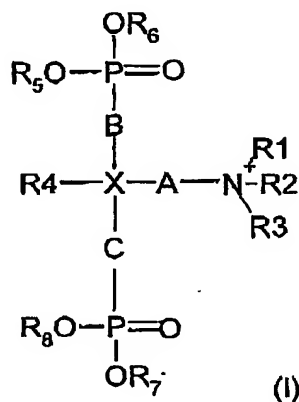
WO 2003/086412 A3

PCT/FR03/01178

## REVENDICATION MODIFIEE

reçue par le Bureau international le 16 Décembre 2003 (16.12.2004)  
revendication originale 1 remplacées par une revendication modifiée 1 (1 page).

1. Médicament contenant en tant que principe actif le composé polyphosphonate de formule générale I :

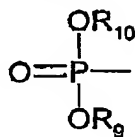


5

Dans laquelle :

- 1) R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub> représentent indépendamment l'un de l'autre un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle ou aryle en C1-C6 ;
- 2) X est un atome de carbone C ou un atome d'azote N ;
- 3) A représente un groupe alkyle ou aryle en C1-C6, un groupe carbonyle ou un groupe hydrophile, B et C représentent une liaison chimique, un groupe alkyle ou aryle en C1-C6, un groupe carbonyle, ou un groupe hydrophile ;
- 4) R<sub>4</sub> représente :
  - a) soit un atome d'hydrogène, un groupe OH, un groupe alkyle ou aryle en C1-C6, ou un acide carboxylique en C1-C6, un doublet libre (si X est un azote N) ;
  - b) soit un phosphonate de formule :

15



20

dans laquelle R<sub>9</sub>, R<sub>10</sub> représentent indépendamment l'une de l'autre un atome d'hydrogène, ou un groupe alkyle ou aryle en C1-C6 ;

- c) soit un groupe ammonium quaternaire de formule